

(19) 世界知的所有権機関
国際事務局



(43) 国際公開日
2005年9月1日 (01.09.2005)

PCT

(10) 国際公開番号
WO 2005/080582 A1

(51) 国際特許分類: C12N 15/87, A61K
31/7088, 47/48, A61P 43/00, 35/00, 35/02

[JP/JP]; 〒8200011 福岡県飯塚市柏の森 1 1-6 近畿
大学産業理工学部内 Fukuoka (JP).

(21) 国際出願番号: PCT/JP2005/002743

(74) 代理人: 阿形 明, 外(AGATA, Akira et al.); 〒1050004
東京都港区新橋二丁目 1 2 番 5 号池伝ビル 3 階 阿
形特許事務所 Tokyo (JP).

(22) 国際出願日: 2005年2月21日 (21.02.2005)

(25) 国際出願の言語: 日本語

(81) 指定国 (表示のない限り、全ての種類の国内保護が
可能): AE, AG, AL, AM, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BR,
BW, BY, BZ, CA, CH, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK, DM,
DZ, EC, EE, EG, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, HR, HU,
ID, IL, IN, IS, KE, KG, KP, KR, KZ, LC, LK, LR, LS, LT,
LU, LV, MA, MD, MG, MK, MN, MW, MX, MZ, NA, NI,
NO, NZ, OM, PG, PH, PL, PT, RO, RU, SC, SD, SE, SG,
SK, SL, SY, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ,
VC, VN, YU, ZA, ZM, ZW.

(26) 国際公開の言語: 日本語

(30) 優先権データ:
特願2004-045488 2004年2月20日 (20.02.2004) JP
特願2004-136228 2004年4月30日 (30.04.2004) JP

(71) 出願人 (米国を除く全ての指定国について): 独立
行政法人産業技術総合研究所 (NATIONAL INSTI-
TUTE OF ADVANCED INDUSTRIAL SCIENCE AND
TECHNOLOGY) [JP/JP]; 〒1008921 東京都千代田区
霞が関一丁目 3 番 1 号 Tokyo (JP). 学校法人近畿大
学 (KINKI UNIVERSITY) [JP/JP]; 〒5778502 大阪府
東大阪市小若江 3 丁目 4 番 1 号 Osaka (JP). 財団法
人北九州産業学術推進機構 (KITAKYUSHU FOUN-
DATION FOR THE ADVANCEMENT OF INDUSTRY
SCIENCE AND TECHNOLOGY) [JP/JP]; 〒8080135
福岡県北九州市若松区ひびきの 2 番 1 号 Fukuoka
(JP).

(84) 指定国 (表示のない限り、全ての種類の広域保護
が可能): ARIPO (BW, GH, GM, KE, LS, MW, MZ, NA,
SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), ユーラシア (AM, AZ,
BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), ヨーロッパ (AT, BE,
BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, HU,
IE, IS, IT, LT, LU, MC, NL, PL, PT, RO, SE, SI, SK, TR),
OAPI (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, ML,
MR, NE, SN, TD, TG).

(72) 発明者; および

(75) 発明者/出願人 (米国についてのみ): 大庭 英樹 (OBA,
Hideki) [JP/JP]; 〒8410052 佐賀県鳥栖市宿町字野々
下 8 0 7 番地 1 独立行政法人産業技術総合研究所九
州センター内 Saga (JP). 藤井 政幸 (FUJII, Masayuki)

添付公開書類:

- 国際調査報告書
- 電子形式により別個に公開された明細書の配列表部
分、請求に基づき国際事務局から入手可能

2 文字コード及び他の略語については、定期発行される
各PCTガゼットの巻頭に掲載されている「コードと略語
のガイダンスノート」を参照。

(54) Title: CYTOPLASMIC LOCALIZATION DNA AND RNA

(54) 発明の名称: 細胞質局在化 DNA 及び RNA

(57) Abstract: It is intended to provide a modified DNA or RNA, the cytoplasmic localization of which has been established, and an siRNA, which is localized in the cytoplasm, shows a high activity and, therefore, is appropriately usable as a genetic drug, by using a means generally applicable to DNAs of various types regardless of original tissues. A cytoplasmic localization DNA or RNA modified with a peptide can be constructed by modifying a DNA fragment with an active hydrogen-containing group on a solid support, fusing a peptide having an active hydrogen-containing group therewith and then removing from the solid support. On the other hand, a cytoplasmic localization siRNA can be obtained by introducing chemical modification group(s) into the 5'-terminus of at least one of the sense chain and the antisense chain constituting the double-strand, or a dangling end of the antisense chain, or both of them.

(57) 要約: 由来する組織に関係なく、各種 DNA に対して普遍的に適用することができる手段で、細胞質局在化を実現した修飾 DNA 又は RNA 並びに細胞質内に局在化して高い活性を示し、遺伝子医薬として好適に利用し得る siRNA を提供する。ペプチドで修飾された細胞質局在化 DNA 又は RNA は、固相担体上において、DNA のフラグメントを活性水素含有基で修飾し、活性水素含有基をもつペプチドを縮合させたのち、固相担体から脱離させることにより製造できる。一方、細胞質局在化 siRNA は、2 本鎖を構成するセンス鎖及びアンチセンス鎖の少なくとも一方における 5' 末端又はアンチセンス鎖のダンダリングエンド或はその両方に化学修飾基を導入することにより得られる。